

(12) 公開特許公報 (A)

平4-5234

(5) Int. Cl.⁵A 61 K 31/52
9/20

識別記号

府内整理番号

(43) 公開 平成4年(1992)1月9日

B 7252-4C
7624-4C

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全4頁)

(5) 発明の名称 カフェインウイスカー抑制錠

(2) 特願 平2-107037

(2) 出願 平2(1990)4月23日

(7) 発明者 中島俊明	東京都豊島区高田3丁目24番1号	大正製薬株式会社内
(7) 発明者 古屋淳	東京都豊島区高田3丁目24番1号	大正製薬株式会社内
(7) 発明者 石崎広昭	東京都豊島区高田3丁目24番1号	大正製薬株式会社内
(7) 発明者 小山雄二	東京都豊島区高田3丁目24番1号	大正製薬株式会社内
(7) 出願人 大正製薬株式会社	東京都豊島区高田3丁目24番1号	
(7) 代理人 弁理士 北川富造		

明細書

1. 発明の名称

カフェインウイスカー抑制錠

2. 特許請求の範囲

1) 颗粒状薬物に粉末状カフェインを配合してなるカフェインウイスカー抑制錠

3. 発明の詳細な説明

(産業上の利用分野)

本発明は錠剤に関し、さらに詳しくはカフェインのウイスカー発生を抑制した、カフェイン配合錠剤に関する。

(従来の技術)

カフェインを配合した錠剤は、内部からカフェインがウイスカー(針状結晶)となって成長し、絡み合って、錠剤の表面がカビの生えたような外観を呈するためその商品価値を著しく損なうという問題があった。

カフェイン配合剤のウイスカー発生を防止するため、カフェイン含有散剤または顆粒剤と炭、無水ケイ酸および／またはモンモリロナイトを混合する方法(特公昭56-37970号公報)やカフェイン類に制酸剤を配合した素錠(特公平2-85214号公報)が開示されている。

(発明が解決しようとする課題)

しかしながら、前者の方法はカフェインのウイスカー発生の抑制が必ずしも十分とは言難い。

また、後者の素錠は、塩基性物質である制酸剤を多量に含むため、錠剤の小型化が困難となるばかりか他の成分と配合禁忌関係におちいる場合もある。

本発明の目的は、確実かつ容易にカフェインのウイスカー発生を防止した、カフェイン配合錠剤を提供することにある。

(課題を解決するための手段)

本発明者らは、前記課題を解決すべく研究した結果、カフェイン以外の薬物は顆粒状とし、カフェインのみ粉末状のまま調製した錠剤はカフェ

インのウイスカー発生を抑制することができるこ
とを見いだして本発明を完成した。

本発明の製剤は、顆粒状薬物に粉末状カフェイ
ンを配合してなるカフェインウイスカー抑制錠で
ある。

本発明で顆粒状薬物とは、薬物に賦形剤、結合
剤、崩壊剤などを加えて均一に混和した後、常法
に従って粒状としたものをいう。

本発明の錠剤は下記の方法で製造することができ
る。

すなわち、カフェインを除く薬物と賦形剤を均
一に混合、粉碎し、これに結合剤を加えて造粒し
た後乾燥するなど常法に従って顆粒状薬物を製造
する。

この顆粒状薬物に滑沢剤、崩壊剤、粉末状カ
フェインなどを添加し、均一に混合後常法に従つ
て打錠して目的の錠剤を製造する。

薬物として、アスピリン、アセトアミノフェ
ン、エテンザミド、サリチル酸アミド、塩酸イソ
チベンジル、塩酸ジフェンヒドロコデイン、マレイン

る。

(発明の効果)

本発明によれば、工程数を増やす必要がないの
できわめて低廉かつ確実にカフェインのウイス
カー発生を抑制したカフェイン配合錠剤を提供す
ることができる。

(実施例)

以下、実施例と試験例を挙げて本発明を詳細に
説明する。

実施例 1

アセトアミノフェン 9g、マレイン酸カルビノ
キサミン 0.075g、リン酸ジヒドロコデイン 0.24
g、ノスカピン 0.48g、d & - 塩酸メチルエ
フェドリン 0.6g、グアヤコールスルホン酸カリウム
2.5g、ビスイブチアミン 0.264g、リボフラビン
0.12g、塩化リゾチーム 0.66g、軽質無水ケ
イ酸 0.6g、結晶セルロース 9.72g、ヒドロキシ
プロビルセルロース 4.5g を V型混合機(発明
作所製)でよく混合し、0.5mmのスクリーンを通して
混合、粉碎した。これにバインダー液を加え

酸カルビノキサミン、d & - マレイン酸クロル
フェニラミン、臭化水素酸デキストロメトルファ
ン、リン酸コデイン、リン酸ジヒドロコデイン、
ノスカピン、d & - 塩酸メチルエフェドリン、
グアヤコールスルホン酸カリウム、カフェイン、
塩酸チアミン、リボフラビン、ビスイブチアミ
ン、アスコルビン酸などを用いることができる。

その他、薬物以外の成分として、滑沢剤(たと
えば、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸
カルシウム、硬化ヒマシ油、タルク、マクロゴー
ル 4000、同 6000、ステアリン酸など)、結合剤(た
とえば、デンプン糊液、ゼラチン溶液、アラビア
ゴム溶液、ヒドロキシプロビルセルロース、ブド
ウ糖液、白糖溶液、水、エタノール、イソプロバ
ノールなど)、賦形剤(たとえば、軽質無水ケイ
酸、炭酸カルシウム、カオリン、結晶セルロー
ス、デンプン、乳糖、白糖、ブドウ糖など)、崩
壊剤(デンプン、寒天、ゼラチン、CMC-N
a、CMC-Ca、結晶セルロース、炭酸カルシ
ウムなど)、着色剤などを配合することができ

て顆粒状とし、これを流動層乾燥機(パウレック
社製)により 60°C で乾燥し、粗碎して顆粒を得
た。

この顆粒に無水カフェイン 2.5g、ステアリン
酸マグネシウム 0.15g および硬化ヒマシ油 0.3
g を粉末状のまま添加し、V型混合機(前記と同
じ)で混合した。

この混合物を 1.0~1.5t の打錠圧で打錠し 90
個の錠剤を得た。

実施例 2

実施例 1 に準じて、アセトアミノフェン 9g、
塩酸イソチベンジル 0.05g、塩酸ジフェンヒド
ロコデイン 0.4g、臭化水素酸デキストロメトルファ
ン 0.24g、リン酸コデイン 0.24g、塩酸ノスカ
ピン 0.24g、アスコルビン酸 2.5g、軽質無水
ケイ酸 3.5g、結晶セルロース 4.5g、ヒドロキ
シプロビルセルロース 8g、乳糖 0.13g を用い
て顆粒を製造した後、これに無水カフェイン 0.75
g、ステアリン酸マグネシウム 0.15g および硬

化ヒマシ油 0.3g を粉末状のまま用いて打錠し、
90個の錠剤を得た。

実施例 3

実施例1に準じて、エテンザミド 7.5g、アセトアミノフェン 7g、プロムワレリル尿素 2g、結晶セルロース 4.5g、ヒドロキシプロビルセルロース 7.5g、乳糖 0.3gを用いて顆粒を製造した後、これに無水カフェイン 0.75g、ステアリン酸マグネシウム 0.15gおよび硬化ヒマシ油0.3gを粉末状のまま用いて打錠し、90個の錠剤を得た。

試驗例

実施例1において、無水カフェインは顆粒成分に移して顆粒となし、ステアリン酸マグネシウムと硬化ヒマシ油のみ粉末状のまま顆粒に添加、混合して打錠し、比較錠剤を製造した。

実施例1で得た錠剤、比較錠剤、シリカゲルとともに紙に包んだ比較錠剤および活性炭とともに

紙に包んだ比較錠剤をそれぞれガラスビンに入れ、40°Cと50°Cで保存し、その経時変化を顕微鏡で観察し、下記のスコアにより評価した。

(スコア)

- 0 : ウィスカーノの発生が認められる。
 - 1 : ウィスカーノの発生がわずかに(1~2本)認められる。
 - 2 : ウィスカーノが点々と発生しているのが認められる。
 - 3 : ウィスカーノが密生しているのが認められる。

その結果を第1表に示す。

第 1 表

手 梭 补 正 書 (自 種)

平成2年5月29日

特許庁長官殿



1. 事件の表示

平成 2 年特許願第 107037 号

2. 発明の名称

カフェインウイスカー抑制鏡

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 東京都豊島区高田3丁目2-4番1号

名称 (281) 大正製薬株式会社

代表取締役 上原 明

4. 代理人

住所 〒171 東京都豊島区高田 3 丁目 24 番 1 号

大正製薬株式会社内

電話 (東京) 985-1111

25. 壓
出頭小口

— 2 —

手 続 補 正 書 (自発)

5. 補正命令の日付
自 発

平成 2 年 6 月 29 日

6. 補正の対象

明細書の「発明の詳細な説明」の欄

特許庁長官殿

7. 補正の内容

(1) 明細書第 8 ページ第 5 行を次のとおりに訂正する。

「0：ウィスカの発生が認められない。」

1. 事件の表示

平成 2 年特許願第 107037 号

2. 発明の名称

カフェインウィスカ抑制錠

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 東京都豊島区高田 3 丁目 24 番 1 号

名称 (281) 大正製薬株式会社

代表取締役 上原 明



4. 代理人

住所 〒171 東京都豊島区高田 3 丁目 24 番 1 号

大正製薬株式会社内

電話 (東京) 985-1111

氏名 弁理士 (7411) 北川 富造

5. 補正命令の日付
自 発

6. 補正の対象

明細書の「発明の詳細な説明」の欄

7. 補正の内容

(1) 明細書第 2 ページ第 5 行の「特公平 2-85214 号」を「特開平 2-85214 号」に訂正する。